

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2005 年 9 月 15 日 (15.09.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/085262 A1

- (51) 国際特許分類⁷: C07F 9/38, B01J 31/22, C07B 53/00 // 61/00
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2005/003851
- (22) 国際出願日: 2005 年 3 月 7 日 (07.03.2005)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:
特願2004-065251 2004 年 3 月 9 日 (09.03.2004) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 独立行政法人科学技術振興機構 (JAPAN SCIENCE AND TECHNOLOGY AGENCY) [JP/JP]; 〒3320012 埼玉県川口市本町 4-1-8 Saitama (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小林 修 (KOBAYASHI, Shu) [JP/JP]; 〒1010048 東京都千代田区神田司町 2-1 9 Tokyo (JP).
- (74) 代理人: 下田 昭 (SHIMODA, Akira); 〒1040031 東京都中央区京橋 3-3-4 京橋日英ビル 4 階 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
- 添付公開書類:
— 国際調査報告書
— 補正書
- 補正されたクレームの公開日: 2005 年 11 月 17 日
- 2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING AMINOPHOSPHONIC ACID DERIVATIVE

(54) 発明の名称: アミノホスホン酸誘導体の製法

(57) Abstract: [PROBLEMS] To provide a reaction system in which enantioselective asymmetric nucleophilic addition to an α -iminophosphonic ester is efficiently catalyzed. [MEANS FOR SOLVING PROBLEMS] An α -iminophosphonic ester is subjected to asymmetric addition reaction with a nucleophilic agent (e.g., a silylenol ether) in the presence of a chiral copper catalyst (JP 2003-260363 A) to produce an optically active α -amino- γ -oxophosphonic acid derivative.

(57) 要約: 【課題】 α -イミノホスホン酸エステルへのエナンチオ選択的な不斉求核付加反応を効率的に触媒する反応系を提供する。【解決手段】 キラル銅触媒 (特開2003-260363) の存在下で α -イミノホスホン酸エステルと求核剤 (例えば、シリルエノールエーテル) との不斉付加反応により光学活性 α -アミノ- γ -オキシホスホン酸誘導体を製造する。

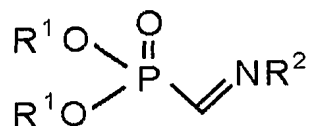


WO 2005/085262 A1

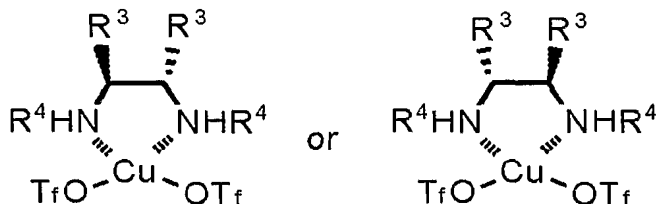
補正書の請求の範囲

[2005年8月26日(26.08.05)国際事務局受理：出願当初の請求の範囲5は補正された；他の請求の範囲は変更なし。]

1. 下式(化1)

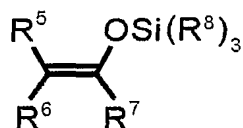


- 5 (式中、 R^1 はアルキル基、 R^2 はアミノ基の保護基を表す。)で表される α -イミノホスホン酸エステルと求核剤を反応させることからなり、下式(化2)



- (式中、 R^3 及び R^4 は、同一であっても異なってもよく、アリール基又はアラ
ルキル基を表す。)で表されるキラル銅触媒の存在下で行うアミノホスホン酸誘
導体の製法。

2. 前記求核剤が下式(化3)

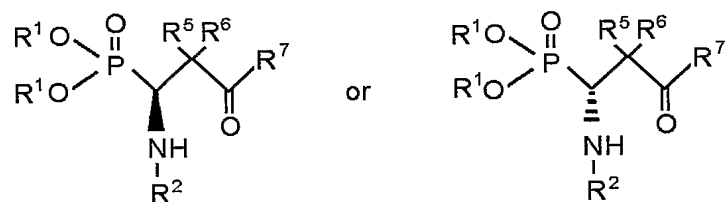


- (式中、 R^5 及び R^6 は、同一であっても異なってもよく、水素原子、アルキル
基、アリール基又はアラルキル基を表し、 R^7 は置換基を有していてもよいアル
キル基、アリール基、アラルキル基、アルコキシ基又はスルフィド基($-\text{SR}^9$;
15 R^9 はアルキル基又はアリール基を表す。)を表し、 R^8 は、それぞれ同一であ
っても異なってもよく、アルキル基又はフェニル基を表す。)で表されるシリル
エノールエーテルである請求項1に記載の製法。

3. 反応系に活性プロトンを持つ化合物を添加剤として加える請求項1又は
20 2に記載の製法。

4. 前記添加剤がヘキサフルオロイソプロピルアルコール(HFIP)であ
る請求項3に記載の製法。

5. (補正後) 前記アミノホスホン酸誘導体が、下式(化4)



(式中、R¹、R²、R⁴、R⁵及びR⁷は前記と同様に定義される。) で表される
請求項1～4のいずれか一項に記載の製法。